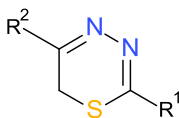


ИССЛЕДОВАНИЕ АНТИОКСИДАНТНОЙ АКТИВНОСТИ СОЕДИНЕНИЙ РЯДА 1,3,4-6H-ТИАДИАЗИНА

Рязанцева Ю.М., Саватеева Е.А., Цейтлер Т.А., Сидорова Л.П., Емельянов В.В.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Широкая распространенность сахарного диабета диктует необходимость поиска новых фармакологических средств коррекции данной патологии. Актуальной задачей фармакологии является разработка лекарственных средств с множественными механизмами действия. В предыдущих исследованиях было показано, что замещенные 1,3,4-6H-тиадиазины (см. рисунок), проявляют противодиабетическую активность в эксперименте на животных, снижая выраженность гипергликемии, гликирования белков и оксидативного стресса.



1,3,4-6H-тиадиазин

R¹ = Alk, Het

R² = Ar, Het

Структура соединений ряда 1,3,4-6H-тиадиазина.

С целью оптимизации отбора замещенных 1,3,4-6H-тиадиазинов для эксперимента *in vivo* была изучена антиоксидантная активность 28 соединений, отличающихся природой заместителя в положении 2- и 5-тиадиазинового цикла. Антиоксидантную активность исследовали в модельной системе *in vitro* по ингибированию окисления аскорбиновой кислоты кислородом воздуха в присутствии соединения. В качестве характеристики антиоксидантной активности рассчитывали концентрацию полумаксимального ингибирования (IC₅₀).

Все исследованные вещества проявили дозозависимую способность ингибировать окисление аскорбиновой кислоты кислородом воздуха, причём скорость её окисления в присутствии 1,3,4-6H-тиадиазинов снижалась от 1,4 до 7 раз по сравнению с контролем.

Расчет IC₅₀ показал, что наивысшую антиоксидантную активность проявляли 4 исследованных соединения (IC₅₀ от 2,49 ± 0,07 до 3,03 ± 0,36 ммоль/л), превосходя вещество сравнения глутатион восстановленный, IC₅₀ 3,16 ± 0,28 ммоль/л. При анализе взаимосвязи «структура - антиоксидантная активность», установлено, что активные антиоксиданты имеют морфолиновый заместитель в положении 2 и галогенфенильный или фенильный заместитель в положении 5 тиadiaзинового цикла.